### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



## 

### (43) 国際公開日 2005年1月6日(06.01.2005)

### **PCT**

## (10) 国際公開番号 WO 2005/000803 A2

(51) 国際特許分類7:

**C07D** 

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/009350

(22) 国際出願日:

2004年6月25日(25.06.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2003-189096 2003年6月30日(30.06.2003) JP 特願 2003-421688

2003年12月18日(18.12.2003)

- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 住友化 学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED.) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁 目27番1号 Tokyo (JP).
- (71) 出願人 および
- (72) 発明者 (日本. 米国についてのみ): 竹本 佳司 (TAKE-MOTO, Yoshiji) [JP/JP]; 〒5200827 滋賀県大津市池の 里29-16 Shiga (JP).

- (74) 代理人: 高島 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目2番14号藤村 大和生命ビル Osaka (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が 可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI. GB, GD, GE, GH, GM, HR. HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可 能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

/続葉有/

(54) Title: ASYMMETRIC UREA COMPOUND AND PROCESS FOR PRODUING ASYMMETRIC COMPOUND BY ASYM-METRIC CONJUGATE ADDITION REACTION WITH THE SAME AS CATALYST

(54) 発明の名称: 不斉尿素化合物およびこれを触媒として用いる不斉共役付加反応による不斉化合物の製造方法

(57) Abstract: A process for producing an asymmetric compound (IV), characterized by causing a compound (II) to add a nucleophilic reagent (III) through conjugate addition in the presence of an asymmetric urea compound (I). Also provided is a nonmetallic asymmetric catalyst capable of realizing asymmetric conjugate addition reaction which attain high yield and are highly stereoselective. The process is an advantageous process for producing an asymmetric compound by an asymmetric conjugate addition reaction in which the catalyst is used. [In the formulae, X represents oxygen or sulfur; C\*, C\*\*, and C\*\*\* each indicates asymmetric carbon; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, and R<sup>10</sup> each represents optionally substituted lower alkyl, etc., provided that, for example, R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> may be bonded to each other to form an optionally substituted homocycle, etc.; R3 represents optionally substituted aryl, etc.; R6 and R7 each represents hydrogen, etc.; Nu represents -CR16(COR17)(COR18) (wherein R16, R17, and R18 each represents optionally substituted lower alkyl, etc.), etc.; and EWG represents an electron-withdrawing group.]

A2

## 訂正版

## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# 

(43) 国際公開日 2005 年1 月6 日 (06.01.2005)

**PCT** 

(10) 国際公開番号 WO 2005/000803 A3

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 275/30, 201/12, 205/53, 231/10, 235/78, 335/16, C07D 209/56 // C07M 7:00
- (21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/009350

(22) 国際出願日:

2004年6月25日(25.06.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2003-189096 2003年6月30日(30.06.2003) JP 特願2003-421688

2003年12月18日(18.12.2003) JP

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED.) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目 27番1号 Tokyo (JP).
- (71) 出願人 および
- (72) 発明者 (日本. 米国についてのみ): 竹本 佳司 (TAKE-MOTO, Yoshiji) [JP/JP]; 〒5200827 滋賀県大津市池の里29-16 Shiga (JP).

- (74) 代理人: 髙島 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目2番14号 藤村 大和生命ビル Osaka (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

- (54) Title: ASYMMETRIC UREA COMPOUND AND PROCESS FOR PRODUCING ASYMMETRIC COMPOUND BY ASYMMETRIC CONJUGATE ADDITION REACTION WITH THE SAME AS CATALYST
- (54) 発明の名称: 不斉尿素化合物およびこれを触媒として用いる不斉共役付加反応による不斉化合物の製造方法

(57) Abstract: A process for producing an asymmetric compound (IV), characterized by causing a compound (II) to add a nucle-ophilic reagent (III) through conjugate addition in the presence of an asymmetric urea compound (I). Also provided is a nonmetallic asymmetric catalyst capable of realizing asymmetric conjugate addition reaction which attain high yield and are highly stereoselective. The process is an advantageous process for producing an asymmetric compound by an asymmetric conjugate addition reaction in which the catalyst is used. [In the formulae, X represents oxygen or sulfur; C\*, C\*\*, and C\*\*\* each indicates asymmetric carbon; R¹, R², R⁴, R⁵, R®, R⁰, and R¹⁰ each represents optionally substituted lower alkyl, etc., provided that, for example, R⁴ and R⁵ may be bonded to each other to form an optionally substituted homocycle, etc.; R³ represents optionally substituted aryl, etc.; R⁶ and R७ each represents hydrogen, etc.; Nu represents -CR¹⁶(COR¹⁷)(COR¹⁷) (wherein R¹⁶, R¹⁷, and R¹⁷ each represents optionally substituted lower alkyl, etc.), etc.; and EWG represents an electron-withdrawing group.]